

⑨ 日本国特許庁(JP)

⑩ 特許出願公開

⑪ 公開特許公報(A)

昭60-226868

⑫ Int. Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑬ 公開 昭和60年(1985)11月12日

C 07 D 293/12
A 61 K 31/41
31/425

ABG

7330-4C
7330-4C
7330-4C

※審査請求 未請求 発明の数 3 (全24頁)

⑭ 発明の名称 ベンズイソセレンアゾールチオン類の製法

⑮ 特 願 昭60-37804

⑯ 出 願 昭60(1985)2月28日

優先権主張 ⑰ 1984年3月1日 ⑱ 西ドイツ(DE) ⑲ P 3407511.9

⑳ 発 明 者 アンドレ・ヴェルテル ドイツ連邦共和国デー5024プルハイム・ライエルヴェーク11アー

㉑ 出 願 人 アー・ナッターマン・ウント・シー・ゲゼルシャフト・ミット・ベシユレンクテル・ハフツング
ドイツ連邦共和国デー5000ケルン30・ナッターマンアレー1

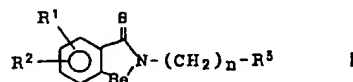
㉒ 代 理 人 弁理士 佐藤 辰男 外2名
最終頁に続く

明 細 書

1 発明の名称 ベンズイソセレンアゾールチオン類の製法

2 特許請求の範囲

1) 一般式 I



(式中、R¹ および R² は同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、ハロゲン、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-アルコキシ、トリフルオロメチルまたはニトロであることができるかあるいは R¹ と R² は一緒になつてメチレンジオキシを表すことができ、n は 0 かまたは 1~4 の整数であり、R⁵ は水素原子、フェニル基を表すかあるいはハロゲン、アルキル、アルコキシ、トリフル

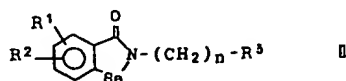
オロメチル、ニトロまたはメチレンジオキシによりモノ置換またはジ置換されているフェニル基であるかあるいはチオフエン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、ベンゾトリアジン類、ベンゾチオフエン類、ベンゾチアジアゾール類、トリアジン類、トリアゾール類、テトラゾール類、キノリン類、イソキノリン類、インドール類およびインダゾール類からなる群より選択され、しかもこれらがハロゲン、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-アルコキシ、メルカプト、C₁~C₄-アルキルメルカプト、フェニル、ニトロおよびトリフルオロメチルからなる群より選択される同一または異なる置換基によ

リモノ置換またはジ置換されうる、窒素および/または硫黄の元素である1～4個のヘテロ原子を有する複素環式基である)のベンズイソセレナゾールチオン類。

- 2) 式中、 R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいは R^1 と R^2 が一緒になつてメチレンジオキシを表しそして n が2～4の整数であり、他方 R^3 が水素を表す前記特許請求の範囲第1項の記載によるベンズイソセレナゾールチオン類。
- 3) 式中、 R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、弗素、塩素、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいは R^1 と R^2 が一緒になつてメチレンジオキシを表しそして

類、ピラジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、トリアジン類、トリアゾール類およびテトラゾール類からなる群より選択され、しかもこれらが弗素、塩素、メチル、エチル、ブチル、メトキシ、エトキシ、メルカプト、メチルメルカプト、エチルメルカプト、ニトロ、フェニルまたはトリフルオロメチルからなる群より選択される同一または異なつた置換基によりモノ置換またはジ置換されうる、窒素および/または硫黄の元素である1～4個のヘテロ原子を有する複素環式基を表す前記特許請求の範囲第1項の記載によるベンズイソセレナゾールチオン類。

5) 一般式Ⅱ



て n が0かまたは1～4の整数であり、他方 R^3 がフェニル基を表すかまたは弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロ、トリフルオロメチルまたはメチレンジオキシによりモノ置換またはジ置換(置換基は同一でも異なつていてもよい)されているフェニル基を表す前記特許請求の範囲第1項の記載によるベンズイソセレナゾールチオン類。

- 4) 式中、 R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいは R^1 と R^2 が一緒になつてメチレンジオキシを表すことができそして n が0であり、他方 R^3 がチオフェン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン

(式中、 R^1 、 R^2 および R^3 として n は前記特許請求の範囲第1項に記載の定義を有する)のベンズイソセレナゾロンを適当な芳香族炭化水素中においてそれ自体既知の方法で五硫化二りんと反応させて相当するチオンを得ることを特徴とする前記特許請求の範囲第1～4項に記載された化合物の製法。

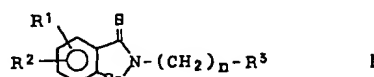
- 6) 式中の R^1 、 R^2 および R^3 として n が前記特許請求の範囲第1項に記載の定義を有する一般式Ⅱのベンズイソセレナゾロンを適当な芳香族炭化水素中においてそれ自体既知の方法で2,4-ビス-(4-メトキシフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン(ラウエソン試薬)の作用により相当するチオンに変換することを特徴とする前記特許請求の範囲第1～4項の記載による化合物の製法。

7) 在来の製薬上の補助剤および佐薬と混合させた、活性化合物としての前記特許請求の範囲第1～4項の記載による式1の化合物を含有することを特徴とする医薬製品。

5. 発明の詳細な説明

本発明は新規ベンズイソセナゾールチオン類、それらの製法およびリウマチ性型の炎症疾患治療用の医薬における活性化合物としてのそれらの用途に関する。

本発明による化合物は一般式1



(式中、 R^1 および R^2 は同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、ハロゲン、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ、トリフルオロメチルまたはニトロである

ル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ、メルカプト、 $C_1\sim C_4$ -アルキルメルカプト、フェニル、ニトロおよびトリフルオロメチルからなる群より選択される同一または異なる置換基によりモノ置換またはジ置換されうる、窒素および/または硫黄の元素である1～4個のヘテロ原子を有する複素環式基である)で表わされるものである。

好ましい化合物は式中、 R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいは R^1 と R^2 が一緒になつてメチレンジオキシを表すことができそして n が0かまたは1～4の整数であり、他方 R^3 が水素、フェニル基を表すかあるいは弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロ、トリフルオロメチルまたはメチレンジオキシによりモノ置換またはジ置換(置換

ことができるかあるいは R^1 と R^2 は一緒になつてメチレンジオキシを表すことができ、 n は0かまたは1～4の整数であり、 R^3 は水素原子、フェニル基を表すかあるいはハロゲン、アルキル、アルコキシ、トリフルオロメチル、ニトロまたはメチレンジオキシによりモノ置換またはジ置換されているフェニル基であるかあるいはチオフエン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、ベンゾトリアジン類、ベンゾチオフエン類、ベンゾチアジアゾール類、トリアジン類、トリアゾール類、テトラゾール類、キノリン類、イソキノリン類、インドール類およびインダゾール類からなる群より選択され、しかもこれらがハロゲン、 $C_1\sim C_4$ -アルキ

基は同一であるかまたは異なっていることができる)されているフェニル基を表す化合物である。

これに加えてまた好ましい化合物は式中、 R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいは R^1 と R^2 が一緒になつてメチレンジオキシを表すことができ、 n が0であり、他方 R^3 がチオフエン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、トリアジン類、トリアゾール類およびテトラゾール類からなる群より選択されしかもこれらが弗素、塩素、メチル、エチル、ブチル、メトキシ、エトキシ、メルカプ

ト、メチルメルカプト、エチルメルカプト、ニトロ、フェニルおよびトリフルオロメチルからなる群より選択される同一または異なる二つた置換基によりモノ置換またはジ置換されうる、窒素および/または硫黄の元素である1~4個のヘテロ原子を有する複素環式基を表す化合物である。

本発明による化合物の例としては以下のものがあげられる。

2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-フルオロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-メチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-

チオン、6-トリフルオロメチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、7-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-ニトロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、4-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5,6-ジクロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジクロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジメチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-メチレンジオキシ-2-エチル-1,2-ベン

ズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-ブチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(フェニルメチル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(4-フェニルブチル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-クロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-フルオロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-メチル-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-トリフルオロメチル-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、7-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイ

ソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-クロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-ニトロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、4-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5,6-ジクロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジクロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-メチレンジオキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2

- (4 - フルオロフェニル) - 1,2 - ペンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 2 - (2 -
 クロロフェニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、 2 - (3 - クロロフェ
 ニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、 2 - (4 - クロロフェニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (2 - トリフルオロメチルフェニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (2 - メチルフェニル) - 1,2 - ペンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 2 - (3 -
 メチルフェニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、 2 - (4 - メチルフェ

ニル) - 1,2 - ペンズイソセリナゾール - 3(2H) -
 - チオン、2 - (2 - メトキシフエニル) - 1,2 -
 - ペンズイソセリナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (3 - メトキシフエニル) - 1,2 - ペンズ
 イソセリナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4
 - メトキシフエニル) - 1,2 - ペンズイソセ
 リナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2,4 - ジメ
 トキシフエニル) - 1,2 - ペンズイソセリナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (2,5 - ジメトキ
 シフエニル) - 1,2 - ペンズイソセリナゾール
 - 3(2H) - チオン、2 - (3,4 - ジメトキシフ
 エニル) - 1,2 - ペンズイソセリナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (3,5 - ジメトキシフエ
 ニル) - 1,2 - ペンズイソセリナゾール - 3(2H)
 - チオン、2 - (2,3 - ジメチルフエニル) -
 1,2 - ペンズイソセリナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (2,4 - ジメチルフエニル) - 1,2 -

ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2,5 - ジメチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2,6 - ジメチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3,4 - ジメチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3,5 - ジメチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - クロロ - 4 - メチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - クロロ - 6 - メチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - クロロ - 2 - メチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - クロロ - 4 - メチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ -

2 - メチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - クロ
ロ - 2 - メチルフエニル) - 1,2 - ペンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - フル
オロ - 2 - メチルフエニル) - 1,2 - ペンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 -
フルオロ - 3 - メチルフエニル) - 1,2 - ペン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4
- フルオロ - 2 - メチルフエニル) - 1,2 - ペ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(3 - フルオロ - 4 - メチルフエニル) - 1,2
- ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (2 - フルオロ - 4 - メチルフエニル) -
1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
ン、2 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル)
- 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル)

ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
 - チオン、2 - (2 - ニトロフエニル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
 - (3 - ニトロフエニル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - ニ
 トロフエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ル - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メトキシ - 2
 - ニトロフエニル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - メチル -
 4 - ニトロフエニル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル
 - 2 - ニトロフエニル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - メチ
 ル - 3 - ニトロフエニル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - メ
 チル - 5 - ニトロフエニル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3,4 -

メチレンジオキシフェニル) - 1,2 - ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 -
ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (3 - ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (4 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレ
ナゾール - 3(2H) - チオン、6 - クロロ - 2 -
(2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - チオン、6 - フルオロ - 2 -
(2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - チオン、6 - メチル - 2 - (2 -
ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、6 - メトキシ - 2 - (2 - ピ
リジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、6 - トリフルオロメチル - 2 -
(2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - チオン、7 - メトキシ - 2 -

(2 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 5 - クロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 5 - メトキシ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 4 - メトキシ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 5,6 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 6,7 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 2 - (2 - クロロ - 3 - ピリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)

- チオン、 2 - (2 - メトキシ - 5 - ピリジル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、 2 - (3 - ニトロ - 2 - ピリジル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (5 - ニトロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、 2 - (3
 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、 2 - (4 - メ
 チル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、 2 - (5 - メチル
 - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、 2 - (6 - メチル - 2
 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - チオン、 2 - (3,5 - ジクロロ - 2
 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - チオン、 2 - (2,6 - ジクロロ - 3
 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール

- 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジメチル - 2 -
 - ビリジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - チオン、2 - (5 - クロロ - 2 - ビ
 リジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2 - ビリ
 ジル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、2 - (2 - ビリミジニル) - 1,2 -
 ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6
 - クロロ - 2 - (2 - ビリミジニル) - 1,2 -
 ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6
 - フルオロ - 2 - (2 - ビリミジニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 6 - メチル - 2 - (2 - ビリミジニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 6 - メトキシ - 2 - (2 - ビリミジニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 6 - トリフルオロメチル - 2 - (2 - ビリミジ

ニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、7 - メトキシ - 2 - (2 - ビリミジ
 ニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、5 - クロロ - 2 - (2 - ビリミジニ
 ル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、5 - メトキシ - 2 - (2 - ビリミジ
 ニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、5 - ニトロ - 2 - (2 - ビリミジニ
 ル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、4 - メトキシ - 2 - (2 - ビリジニ
 ル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 - ビリミ
 ジニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2 -
 ビリミジニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、6,7 - メチレンジオキシ
 - 2 - (2 - ビリミジニル) - 1,2 - ペンズイ

ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 -
 メチル - 2 - ビリミジニル) - 1,2 - ペンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 -
 ニトロ - 2 - ビリミジニル) - 1,2 - ペンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6
 - ジメチル - 2 - ビリミジニル) - 1,2 - ペン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
 (2,6 - ジメチル - 4 - ビリミジニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (6 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 4
 - ビリミジニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2
 - メチルメルカプト - 6 - ビリミジニル) -
 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (4 - クロロ - 6 - メチル - 2 - ビリ
 ミジニル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 3 - ニト

ロ - 2 - ビリミジニル) - 1,2 - ペンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - クロ
 ロ - 5 - ニトロ - 4 - ビリミジニル) - 1,2 -
 ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (4,6 - ジクロロ - 2 - ビリミジニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (4,6 - ジクロロ - 5 - ビリミジニル) - 1,2
 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (4,6 - ジメルカプト - 2 - ビリミジニル)
 - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (2 - ペンゾチアゾリル) - 1,2 -
 ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (4 - クロロ - 2 - ペンゾチアゾリル) -
 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (4 - メトキシ - 2 - ペンゾチアゾリ
 ル) - 1,2 - ペンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、2 - (6 - メトキシ - 2 - ペンゾチ

アゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - メチル - 5 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - ニトロ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - フルオロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メチル - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - チオン、6 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオロメチル - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、7 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - ニトロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、4 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2

- チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メチル - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ニトロ - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - クロロ - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - メチル - 5 - イソチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - イミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -

(1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メルカプト - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メチル - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - トリフルオロメチル - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - 第3ブチル - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ピラジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ピリダジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

- チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンズ
イミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ベンゾトリア
ゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (7 - クロロ - 1,2,4 -
ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (1,2,4
- ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (7
- フルオロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 -
イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (7 - ニトロ - 1,2,4 - ベンゾ
トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ベン
ゾチエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - チオン、2 - (3 - ベンゾチエニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ

ゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - テトラゾ
リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (5 - キノリル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 -
メチル - 4 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - ニト
ロ - 5 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - キノリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (3 - キノリル) - 1,2 - ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (8 -
キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (6 - メトキシ - 8 - キ
ノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (1 - イソキノリル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
ン、2 - (5 - イソキノリル) - 1,2 - ベンズ

オン、2 - (2 - チエニル) - 1,2 - ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2,1,3
- ベンゾチアジゾール - 4 - イル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(1,2,4 - トリアジン - 4 - イル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(2,6 - ジメルカプト - 1,3,5 - トリアジン -
4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 1,2,4
- トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5,6 -
ジフエニル - 1,2,4 - トリアジン - 3 - イル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (1,2,4 - トリアゾール - 4 - イル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (5 - メルカプト - 1,2,4 - トリア
ゾール - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナ

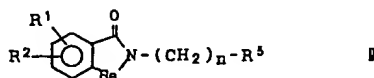
イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5
- インドリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - チオン、2 - (5 - イソインドリ
ル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
チオン、2 - (5 - インダゾリル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(6 - クロロ - 3 - インダゾリル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオンおよび
2 - (7 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - チオン。

本発明による式 I のベンズイソセレナゾール
チオン類は多数の病気の治療に使用されうる。
それらは特に免疫系を刺激する感染症の予防お
よび治療のためにおよびたたとえばウェー・クラ
ウス氏 (W. Kraus) および P. オエーメ氏 (P.
Oehme) による「ダス・ドイト・ゲズントハイッ
グエーゼン (Das Deut. Gesundheitswesen)」

[ザ・ジャーマン・ヘルス・サービス(The German Health Service)], 1979, 34(37), 1713~1718および1979, 34(37), 1769~1773に定義されているようなセレン欠乏症の治療のために使用される。

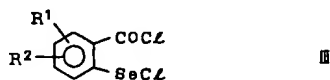
式Ⅰのベンズイソセレナゾールチオン類は特にたとえば関節症または慢性多発関節炎のようなリウマチ性病気の治療に使用され、これら新規化合物は無毒性でありしかも既知の消炎性治療剤に対比して潰瘍形成または胃腸刺激を全く示さないの点で優れた耐性を有する点に特徴がある。

一般式Ⅰの新規ベンズイソセレナゾールチオン類はそれ自体既知である方法で得られる。たとえば一般式Ⅱ

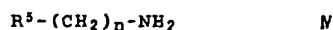


ム(Nouv. J. Chim.)」4, 47, 1980を参照されたい)。

出発化合物として使用される式Ⅱのベンズイソセレナゾール類は既知である[たとえばアール・レセル氏およびアール・バイス氏による「ベル(Ber.)」57(1924)、独国公明特許第3027,073号および同第3027,075号の各明細書参照されたい]かまたはそれらはこれらの参考書に記載の方法により、式Ⅲ



(式中、R¹およびR²は式Ⅰに記載の定義を有する)のo-クロロセレンベンゾイルクロライドを式N



(式中、R⁵およびnは式Ⅰに記載の定義を有する)のアミンと反応させることにより得ること

(式中、R¹、R²およびR⁵そしてnは式Ⅰに記載の定義を有する)の化合物を適当な溶媒中で加熱することにより五硫化二リンと反応させて相当するチオンを得る。この際70°~150℃、好ましくは80°~110℃の温度でたとえばベンゼン、トルエンまたはキシレンのような芳香族炭化水素を用いるのが好ましい。

式中、R¹、R²およびR⁵そしてnが式Ⅰに記載の定義を有する一般式Ⅱの化合物も出発物質として使用される別法では相当するチオンへの変換は70°~150℃、好ましくは110℃の温度での、たとえばトルエンまたはキシレンのような不活性溶媒中における2,4-ビス-(4-メトキシフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフエタン(ラウエソン試薬)(Lawesson reagent)の作用により実施される(エル・シャバナ氏等による「ヌーブ・ジ・シ

ができる。前記の相当するo-クロロセレンベンゾイルクロライド類はA. ルウエット氏およびM. レンソン氏による「ブル・ソック・シム・ベルグ(Bull. Soc. Chim. Belg.)」1966, 75, 157~163に記載の方法にしたがつて製造される。

式Ⅱの可能な出発化合物の例としてはたとえば以下のものがあげられる。

2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-フルオロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-メチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-トリフルオロメチル-2-エチル-1,2-ベ

ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、7 - メ
トキシ - 2 - エチル - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、5 - クロロ - 2 - エチ
ル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
オン、5 - メトキシ - 2 - エチル - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、5 - ニト
ロ - 2 - エチル - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、4 - メトキシ - 2 - エチル
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、5,6 - ジクロロ - 2 - エチル - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6,7 - ジ
クロロ - 2 - エチル - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、6,7 - メチレンジオキ
シ - 2 - エチル - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、2 - ブチル - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (フエ
ニルメチル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール

- 3(2H) - オン、2 - (4 - フェニルブチル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、2 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、6 - クロロ - 2 - フェニ
ル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
オン、6 - フルオロ - 2 - フェニル - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6 - メ
チル - 2 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、6 - メトキシ - 2 - フ
エニル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- オン、6 - トリフルオロメチル - 2 - フェニ
ル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
オン、7 - メトキシ - 2 - フェニル - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、5 - ク
ロロ - 2 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、5 - メトキシ - 2 - フ
エニル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)

- オン、5 - ニトロ - 2 - フェニル - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、4 - メ
トキシ - 2 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレ
ナゾール - 3(2H) - オン、5,6 - ジクロロ - 2
- フェニル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - オン、6,7 - ジクロロ - 2 - フェニル
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、6,7 - メチレンジオキシ - 2 - フェニル -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
2 - (2 - フルオロフェニル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (3 -
フルオロフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - フルオロフ
エニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - オン、2 - (2 - クロロフェニル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
2 - (3 - クロロフェニル) - 1,2 - ベンズイ

ソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - ク
ロロフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、2 - (2 - トリフルオロメ
チルフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、2 - (3 - トリフルオロメ
チルフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、2 - (4 - トリフルオロメ
チルフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、2 - (2 - メチルフェニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、2 - (3 - メチルフェニル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4
- メチルフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、2 - (2 - メトキシフ
エニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - オン、2 - (3 - メトキシフェニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ

ン、2-(4-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2,4-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2,5-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3,4-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3,5-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2,3-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2,4-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2,5-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2,6-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3,4-ジメチル

フェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3,5-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2-クロロ-4-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2-クロロ-6-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3-クロロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3-クロロ-4-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(4-クロロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(5-クロロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(5-フルオロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、

2-(4-フルオロ-3-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(4-フルオロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3-フルオロ-4-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2-フルオロ-4-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(4-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、

2-(4-メトキシ-2-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2-メチル-4-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(4-メチル-2-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2-メチル-3-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2-メチル-5-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3,4-メチレンジオキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(2-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、2-(4-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-オン、6-クロロ

- 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - オン、6 - フルオロ - 2
- (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、6 - メチル - 2 - (2
- ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - オン、6 - メトキシ - 2 - (2 - ピ
リジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - オン、6 - トリフルオロメチル - 2 -
(2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、7 - メトキシ - 2 - (2
- ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - オン、5 - クロロ - 2 - (2 - ピリ
ジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- オン、5 - メトキシ - 2 - (2 - ピリジル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、4

- オン、2 - (4 - メチル - 2 - ピリジル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
2 - (5 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (6
- メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (3,5 - ジ
クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4,6 - ジメ
チル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレ
ナゾール - 3(2H) - オン、2 - (5 - クロロ -
2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、2 - (4 - クロロ - 2 - ピ
リジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - オン、2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6
- クロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6 -

- メトキシ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、5,6 -
ジクロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6,7 - ジ
クロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - オン、6,7 - メチ
レンジオキシ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 -
(2 - クロロ - 3 - ピリジル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (2 -
メトキシ - 5 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (3 - ニト
ロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、2 - (5 - ニトロ - 2
- ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - オン、2 - (3 - メチル - 2 - ピリ
ジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)

フルオロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6 -
メチル - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6 - メ
トキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6 - ト
リフルオロメチル - 2 - (2 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、7 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、5 - クロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
5 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、4 -
メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、5,6
 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 6,7 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - ピリミジ
 ニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - オン、2 - (4 - メチル - 2 - ピリミジニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
 ン、2 - (5 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (4,6 - ジメチル - 2 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (2,6 - ジメチル - 4 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (6 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 4
 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ

ール - 3(2H) - オン、2 - (4 - クロロ - 2 -
 メチルメルカプト - 6 - ピリミジニル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2
 - (4 - クロロ - 6 - メチル - 2 - ピリミジニ
 ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
 オン、2 - (6 - クロロ - 3 - ニトロ - 2 - ピ
 リミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン、2 - (2 - クロロ - 5 - ニト
 ロ - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4,6 - ジク
 ロロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4,6 - ジ
 クロロ - 5 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4,6 -
 ジメルカプト - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (2
 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレ

ナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - クロロ -
 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - メトキ
 シ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (6 - メ
 トキシ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - メ
 チル - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (2 -
 メチル - 5 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (6
 - ニトロ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(3H) - オン、2 -
 (5,6 - ジメチル - 2 - ベンゾチアゾリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - オン、6 - クロロ - 2 -

(2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、6 - フルオロ - 2 -
 (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、6 - メチル - 2 - (2
 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、6 - メトキシ - 2 - (2 -
 チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン、6 - トリフルオロメチル - 2
 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - オン、7 - メトキシ - 2 -
 (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、5 - クロロ - 2 - (2
 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、5 - メトキシ - 2 - (2 -
 チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン、5 - ニトロ - 2 - (2 - チア
 ザリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、4 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (4 - メチル - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - ニトロ - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - クロロ - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (3 - メチル - 5 - イソチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (2 - イミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (2 - ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - ベンゾトリアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (7 - クロロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (7 - フルオロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (7 - ニトロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (2 - ベンゾチエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - メル

カプト - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - メルカプト - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - メチル - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - トリフルオロメチル - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - 第3ブチル - 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (2 - ピラジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (2 - ピリダジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (3 - ベンゾチエニル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (2 - チエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (2,1,3 - ベンゾチアジアゾール - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (1,2,4 - トリアジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (2,6 - ジメルカプト - 1,3,5 - トリアジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5,6 - ジメチル - 1,2,4 - トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5,6 - ジフェニル - 1,2,4 - トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (1,2,4 - トリアゾール - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - メル

カプト - 1,2,4 - トリアゾール - 3 - イル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (5 - テトラゾリル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (5 - キノ
 リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - オン、2 - (2 - メチル - 4 - キノリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (6 - ニトロ - 5 - キノリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (2
 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン、2 - (3 - キノリル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 -
 (8 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - オン、2 - (6 - メトキシ - 8
 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン、2 - (1 - イソキノリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、

2 - (5 - イソキノリル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (5 - イン
 ドリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - オン、2 - (5 - イソインドリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (5 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (6 - クロ
 ロ - 3 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - オンおよび 2 - (7 - イ
 ンダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン。

本発明による一般式 I のベンズイソセレナゾ
 ールチオン類は常套手段で製剤に調製されうる。
 活性成分として式 I のベンズイソセレナゾール
 チオン類を含有する製剤を調製するには活性化
 化合物はそのまま用いられうるかあるいは適当
 な製薬上の希釈剤および/または補助剤と組み

合わせて用いられついで常套手段で調製されう
 る。

人および獣の医薬分野ではこの活性化合物
 はたとえば全身にいずれか所望の形態で投与さ
 れるが、ただし適当なレベルの活性化合物が血
 液中または組織中に存在または維持されることが
 保証される必要がある。これは適当な投与量
 における経口的、直腸的または非経口的な投与
 で達成されうる。この活性化合物の製剤はたと
 えば錠剤、糖衣錠、カプセル、坐薬、ゾルまた
 はゲルのような所望の投与に適合される個々の
 投与量の形態で存在するのが有利である。これ
 ら化合物の投与量は通常、1日当たり10～
 1,000mg、好ましくは30～300mgであり、1日
 に1回または数回、好ましくは2～3回に分け
 て投与されうる。たとえば錠剤またはカプセル
 の形態あるいは顆粒または粉末の形態で経口的

に投与されうる剤の調製のために使用される適
 当な補助剤の例としてはたとえば炭酸カルシウ
 ム、りん酸カルシウム、澱粉、糖、ラクトース、
 タルク、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、
 ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ソルビ
 トール、微結晶性セルロース、ポリエチレング
 リコール、カルボキシメチルセルロース、シエ
 ラックなどがあげられる。これら錠剤は常套手
 段で被覆されうる。経口用の液体製剤はシロッ
 プ、エリキシルなどの形態で、水性または油性
 の懸濁液または溶液の形態で存在しうる。これ
 らは常套手段で調製される。注射用製剤は水性
 または油性の懸濁液または溶液、使用前に溶解
 される充填剤と一緒になつた粉状組成物および
 凍結乾燥された製剤などであることができる。
 これらの製剤は常套手段で調製される。また本
 発明による製剤は直腸投与用の坐薬形態である

こともでき、それらはたとえばポリエチレングリコール、ラノリン、カカオバター、ウイテプゾル（登録商標、Witepsol）などとして知られている製薬的に許容しうる補助剤を含有することができる。外用製剤は軟膏またはクリーム of 形態で調製されるのが好ましく、これらは通常の成分を使用して常套手段で調製される。

以下に本発明による化合物の製法を実施例によりより詳細に説明する。

実施例 1 2-フェニル-1,2-ベンズイソセ
レナゾール-3(2H)-チオン

15 ml のトルエン中における 2.75 g (0.01 モル) の 2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オンおよび 2.06 g (0.0051 モル) の 2,4-ビス-(4-メトキシフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフエタン（ラウエソン試薬）の混合物を 5 時間

フェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 187~188℃）、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 129℃）、6-フルオロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 101~103℃）、6-メチル-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 121~123℃）、6-クロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 159~161℃）、6-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 121~122℃）、5-ニトロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 154℃）、5-クロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融

100℃で加熱する。冷却後溶媒を真空蒸留し、ついて油状残留物を 100 ml のエーテル/石油エーテル 25:75 (V/V) で 3 回抽出する。抽出溶液を蒸留した後残留物をシリカゲルカラム上に導入し、ついてトルエン/ヘキサン 7:3 (V/V) で溶離する。

収量: 1.71 g (理論量の 58.7%)、融点: 64~65℃（エタノールから再結晶後）。

以下の化合物が実施例 1 の方法と類似の方法で製造された。

2-(4-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 55~56℃）、2-(4-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 67~69℃）、2-(4-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 64~66℃）、2-(4-ニトロ

点 128℃)、7-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 123~124℃）、6,7-メチレンジオキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 73℃）、2-(5-メチル-2-チアゾリル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 195~196℃）、2-(2,6-ジメチル-4-ピリミジニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 137~139℃）、2-(4,6-ジメチル-2-ピリミジニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 162~163℃）、2-(4,6-ジメチル-2-ピリジニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 141~143℃）、2-(5-クロロ-2-ピリジニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点

171~173℃)、2-(2-メトキシ-5-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点135~136℃)、2-(2,6-ジクロロ-3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点101~102℃)、2-(2-ベンゾチアゾリル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点300~303℃)、2-(2-ピリミジニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点195~196℃)、2-(2-チアゾリル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点189~191℃)、2-(4-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点171~174℃)、2-(3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点179~180℃)、2-(2-ピリジル)-1,2-ベンズイソセ

ナゾール-3(2H)-チオン(融点141~143℃)、2-(2-クロロ-3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点102~103℃)および2-(2-ピラジニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点181~184℃)。

実施例2 2-(3-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン

室温において200mlのキシレン中における18.3g(0.06モル)の2-(3-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオンの混合物に7g(0.03モル)の五硫化二りんを攪拌しながら少量ずつ加える。この反応混合物を7時間80℃に保つ。この澄んだ溶液を樹脂状残留物から傾瀉し、最初は炭酸水素ナトリウム水溶液でついて水で洗浄する。この溶

液を真空中で濃縮した後に残留物をエタノールから再結晶させる。

収量: 9.95g(理論量の51.6%)、融点: 51~52℃。

以下の化合物が実施例2の方法と類似の方法で製造された。

2-(2-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点55~57℃)、2-(3,4-メチレンジオキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点85~88℃)、2-(フェニルメチル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点41℃)、2-(4-フェニルブチル)-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(油状物)、2-エチル-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(油状物)、2-(2-メチルフェニル)-1,2-ベン

ズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(融点65~67℃)および2-ブチル-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン(油状物)。

また以下の化合物が実施例1および2の方法と類似の方法で製造された。

6-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン、6-フルオロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン、6-メチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン、6-トリフルオロメチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン、7-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-チオン、5-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンナゾール-3(2H)-

チオン、5-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-ニトロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、4-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5,6-ジクロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジクロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-メチレンジオキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-トリフルオロメチル-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、4-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5,6-ジクロロ-2-フェニル-1,2-

-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジクロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-クロロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-クロロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(4-クロロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナ

ゾール-3(2H)-チオン、2-(2,4-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,5-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3,4-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3,5-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,3-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,4-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,5-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,6-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3,4-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾ

ール-3(2H)-チオン、2-(3,5-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-クロロ-6-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(4-クロロ-2-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(5-クロロ-2-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(5-フルオロ-2-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(4-

フルオロ - 3 - メチルフエニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4
 - フルオロ - 2 - メチルフエニル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
 (5 - フルオロ - 4 - メチルフエニル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (2 - フルオロ - 4 - メチルフエニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニ
 ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
 チオン、2 - (2 - ニトロフェニル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (3 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベンズイ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メ
 トキシ - 2 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベンズイ

ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 -
 メチル - 4 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4
 - メチル - 2 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2
 - メチル - 3 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2
 - メチル - 5 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - ク
 ロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - フルオ
 ロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メチル -
 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メトキシ - 2
 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオロメ

チル - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、7 - メトキ
 シ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - クロロ -
 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、5 - メトキシ - 2
 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、5 - ニトロ - 2 - (2
 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - チオン、4 - メトキシ - 2 - (2 -
 ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 -
 ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2 -
 ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、6,7 - メチレンジオキシ - 2
 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ

ゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - ニトロ -
 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ル - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ニトロ - 2 -
 ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (3 - メチル - 2 - ピリ
 ジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ピリジル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (5 - メチル - 2 - ピリジル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (6 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (3,5 - ジクロロ - 2 - ピリジル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (4 - クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 -
 クロロ - 2 - (2 - ピリミジン) - 1,2 - ベン

ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - フルオロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メチル - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオロメチル - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、7 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - クロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)

ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 6 - メチル - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 3 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - クロロ - 5 - ニトロ - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジクロロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジクロロ - 5 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジメチルカプト - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メトキシ - 2 - ベンゾチアゾリル)

- チオン、4 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 6 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイ

- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - メトキシ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - メチル - 5 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - ニトロ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メチル - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソ

レナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メトキシ -
 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオ
 ロメチル - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、7 -
 メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 -
 クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - メ
 トキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - ニ
 トロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、4 - メト
 キシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5,6 - ジ
 クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 -

ジクロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7
 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - チアゾリル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (4 - メチル - 2 - チアゾリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (5 - ニトロ - 2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (5 - クロロ - 2 - チアゾリル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (3 - メチル - 5 - イソチアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (2 - イミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - ピ
 ラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (1,3,4 - チアジアゾー
 ル - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー

ル - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メルカプト -
 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (5 - トリフルオロメチル - 1,3,4 - チアジ
 アゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - 第 3 級
 ブチル - 1,3,4 - チアジアゾール) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2
 - ピリダジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ベンズイミ
 ダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 -
 ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ペンゾ
 トリアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - チオン、2 - (7 - クロロ - 1,2,4
 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベン

ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
 (1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (7 - フルオロ - 1,2,4 - ベンゾトリ
 アジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、2 - (7 - ニトロ -
 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (2 - ベンゾチエニル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 -
 ベンゾチエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - チエニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (2,1,3 - ペンゾチアジアゾール -
 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (1,2,4 - トリアジン -
 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - チオン、2 - (2,6 - ジメルカプト -
1,3,5 - トリアジン - 4 - イル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(5,6 - ジメチル - 1,2,4 - トリアジン - 3 -
イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (5,6 - ジフェニル - 1,2,4 -
トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (1,2,4 -
トリアゾール - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メ
ルカプト - 1,2,4 - トリアゾール - 3 - イル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (5 - テトラゾリル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5
- キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - チオン、2 - (2 - メチル - 4 - キ
ノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - チオン、2 - (6 - ニトロ - 5 - キノ
リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (2 - キノリル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3
- キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - チオン、2 - (8 - キノリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (6 - メトキシ - 8 - キノリル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
- (1 - イソキノリル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - イソ
キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (5 - インドリル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (5 - イソインドリル) - 1,2 - ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 -
インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー

ル - 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 3 -
インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - チオンおよび 2 - (7 - インダゾ
リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン。

特許出願人 アー・ナツターマン・ウント・
シー・ゲゼルシャフト・ミット・
ベシュレンクテル・ハフツング

代理人 弁理士 佐藤 辰

同 弁理士 高木 千

同 弁理士 西村 公



第1頁の続き

⑤Int. Cl. 4	識別記号	庁内整理番号
A 61 K 31/44	A B E	6664-4C
31/495		6664-4C
31/505		6664-4C
C 07 D 421/04		7431-4C
517/04		8214-4C
/(C 07 D 421/04		7431-4C
213:00		7138-4C
293:00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		7431-4C
239:00		7166-4C
293:00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		7431-4C
277:00		7330-4C
293:00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		7431-4C
241:00		7166-4C
293:00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		7431-4C
293:00		7330-4C
317:00)		8214-4C
(C 07 D 517/04		8214-4C
293:00		7330-4C
317:00)		8214-4C
⑦発 明 者	ジーグルト・ライツク	ドイツ連邦共和国デー5024プルハイム2アム・クヴェツ ヒエンハウフ21
⑦発 明 者	オイゲン・エツチエン ベルク	ドイツ連邦共和国デー5000ケルン41・ヒルゼヴェーク10